【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第２部門第１区分
【発行日】平成18年11月24日(2006.11.24)

【公表番号】特表2006-502859(P2006-502859A)
【公表日】平成18年1月26日(2006.1.26)
【年通号数】公開・登録公報2006-004
【出願番号】特願2004-545802(P2004-545802)
【国際特許分類】
Ｂ０１Ｊ　13/04　(2006.01)
Ａ０１Ｎ　25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/50　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/192　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　45/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/26　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/32　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/36　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　29/00　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｂ０１Ｊ　13/02　Ａ
Ａ０１Ｎ　25/28
Ａ６１Ｋ　 9/50
Ａ６１Ｋ　31/192
Ａ６１Ｋ　45/00
Ａ６１Ｋ　47/26
Ａ６１Ｋ　47/32
Ａ６１Ｋ　47/36
Ａ６１Ｐ　29/00

【手続補正書】
【提出日】平成18年10月3日(2006.10.3)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
室温で固体である少なくとも一の活性物質Ａ）、
少なくとも一の分散剤Ｂ）、
コーティング材料Ｅ）、及び
場合により添加剤Ｃ）
を含んで成る粉末状活性物質配合物であって、
個々の活性物質粒子は、コーティング材料Ｅ）、特にポリビニルアルコールのコートによって被覆されており、特にアモルファス状態で存在し、１μｍを超えない平均直径を有する配合物。
【請求項２】
活性物質を溶融分散すること及び溶融均質化することと、その後乾燥することを組み合わせることによる、特に請求項１に記載の粉末状の活性物質配合物の製造方法であって、
ａ）室温で固体の少なくとも一の活性物質Ａ）、少なくとも一の分散剤Ｂ）、及び場合

により添加剤Ｃ）を、水相に、特に室温で懸濁させること、
ｂ）少なくとも一の圧縮性流体Ｄ）を、超臨界状態で、加圧下、ａ）で形成される懸濁液に加えること、
ｃ）ｂ）で形成される混合物を加熱して、混合物が含む固体を溶かすこと、
ｄ）得られる分散物を均質化した後、コーティング材料Ｅ）、特にポリビニルアルコールの水溶液を、単独で又は他のコーティング材料Ｅ）との混合物で、及び場合により添加剤Ｃ）と、加えること、
ｅ）分散物の圧力を突然低下させ、特に同時に、分散物を乾燥、好ましくは噴霧乾燥又は凍結乾燥、特に好ましくは噴霧乾燥に付すこと
を特徴とする製造方法。
【請求項３】
適当であれば、予め増量剤及び／又は界面活性物質を用いて希釈した後、請求項１に記載の粉末状活性物質配合物を、目標有機体及び／又はその生息場所に運ぶことを特徴とする活性物質の適用方法。
【請求項４】
請求項２に記載の製造方法を行うための装置であって、少なくとも、圧力を発生するために適するポンプ（３）を介して熱交換器（４）と接続されており、攪拌機が設けられている耐圧容器（２）の中に、加圧下で圧縮性流体Ｄ）を計量するためのデバイスを含んで成り、均質化装置（５）、特にジェット・ディスパーサーが、熱交換器（４）と接続されており、バルブで閉鎖可能なパイプラインが、均質化装置（５）から容器（２）に戻り及び必要であれば、パイプラインが均質化装置（５）からポンプが設けられている冷却回路に導かれ、ここで、冷却回路の出口ラインは計量型ポンプ（９）及び必要であれば混合容器と接続されており、後者から導かれるパイプラインは噴霧乾燥機（１０）と接続されている装置。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９１
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９１】
本発明の粉末配合物を用いて、特に有利な方法で、活性物質Ａ）を運ぶことができる。含まれる活性物質は、容易に生物的に利用でき、活性成分が結晶状態で存在する常套の配合物よりも、実質的により良好である生物学的活性を発現する。
以下に、本発明の主な態様を記載する。
１．
室温で固体である少なくとも一の活性物質Ａ）、
少なくとも一の分散剤Ｂ）、
コーティング材料Ｅ）、及び
場合により添加剤Ｃ）
を含んで成る粉末状活性物質配合物であって、
個々の活性物質粒子は、コーティング材料Ｅ）、特にポリビニルアルコールのコートによって被覆されており、特にアモルファス状態で存在し、１μｍを超えない平均直径を有する配合物。
２．
活性物質Ａ）として、室温で固体の活性医薬物質、好ましくは、イブプロフェン、クロトリマゾール、フルコナゾール、インドキサカルブ、アセチルサリチル酸又はシプロフロキサシン、活性農芸化学物質、好ましくは、殺菌剤、防かび剤、殺虫剤、ダニ駆除剤、線虫駆除剤、軟体動物駆除剤、除草剤及び植物成長調整剤、ビタミン、カロチノイド又はフレーバーを含んで成ることを特徴とする上記１に記載の活性物質配合物。
３．

分散剤Ｂ）として、界面活性を有する、非イオン、アニオン、カチオン又は両性イオン物質を含んで成ることを特徴とする上記１又は２に記載の活性物質配合物。

４．

添加剤Ｃ）として、浸透剤、消泡剤、低温安定剤、防腐剤、色素、再分散剤、分解剤、不活性充填剤又は膜形成剤を含んで成ることを特徴とする上記１～３のいずれかに記載の活性物質配合物。

５．

コーティング材料Ｅ）として、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、糖類、好ましくはブドウ糖、オリゴマーの糖類、特に二糖類、より好ましくはショ糖、又は多糖類を含んで成ることを特徴とする上記１～４のいずれかに記載の活性物質配合物。

６．

１０～５０重量％、好ましくは１５～４０重量％の固体活性物質Ａ）、
好ましくは一般に５～５０重量％、より好ましくは７．５～４０重量％の分散剤Ｂ）、
好ましくは一般に１０～３０重量％、より好ましくは１５～３０重量％のコーティング材料Ｅ）、特にポリビニルアルコール、及び
一般に０～５０重量％、より好ましくは０～４０重量％の添加剤Ｃ）
を含むことを特徴とする上記１～５のいずれかに記載の活性物質配合物。

７．

１０～１０００ｎｍ、より好ましくは４０～５００ｎｍの平均直径（数平均）を有する活性物質粒子を含んで成ることを特徴とする上記１～６のいずれかに記載の活性物質配合物。

８．

コーティング材料Ｅ）、特にポリビニルアルコールコーティングのカプセルであって、５０～５００μｍ、より好ましくは１０～１５０μｍの平均直径のカプセルを含んで成ることを特徴とする上記１～７のいずれかに記載の活性物質配合物。

９．

活性物質を溶融分散すること及び溶融均質化することと、その後乾燥することを組み合わせることによる、特に上記１～８のいずれかに記載の粉末状の活性物質配合物の製造方法であって、
ａ）室温で固体の少なくとも一の活性物質Ａ）、少なくとも一の分散剤Ｂ）、及び場合により添加剤Ｃ）を、水相に、特に室温で懸濁させること、
ｂ）少なくとも一の圧縮性流体Ｄ）を、超臨界状態で、加圧下、ａ）で形成される懸濁液に加えること、
ｃ）ｂ）で形成される混合物を加熱して、混合物が含む固体を溶かすこと、
ｄ）得られる分散物を均質化した後、コーティング材料Ｅ）、特にポリビニルアルコールの水溶液を、単独で又は他のコーティング材料Ｅ）との混合物で、及び場合により添加剤Ｃ）と、加えること、
ｅ）分散物の圧力を突然低下させ、特に同時に、分散物を乾燥、好ましくは噴霧乾燥又は凍結乾燥、特に好ましくは噴霧乾燥に付すこと
を特徴とする製造方法。

１０．

活性物質を溶融分散すること及び溶融均質化することと、その後乾燥することを組み合わせることによる、特に上記１～８のいずれかに記載の粉末状活性物質配合物の製造方法であって、
ａ）室温で固体の少なくとも一の活性物質Ａ）、少なくとも一の分散剤Ｂ）、及び場合により添加剤Ｃ）及び少なくとも一のコーティング材料Ｅ）を、水相に懸濁させること、
ｂ）少なくとも一の圧縮性流体Ｄ）を、超臨界状態で、加圧下、ａ）で形成される懸濁液に加えること、
ｃ）ｂ）で形成する混合物を加熱して、混合物が含む固体を溶かすこと、
ｄ）得られる分散物を均質化すること、

ｅ）分散物の圧力を突然低下させ、特に同時に、分散物を乾燥、好ましくは噴霧乾燥又は凍結乾燥、特に好ましくは噴霧乾燥に付すこと
を特徴とする製造方法。
１１．
工程ａ）を、１０℃～３０℃の温度で、好ましくは室温で行うことを特徴とする上記９又は１０に記載の製造方法。
１２．
工程ｂ）を、５０，０００～５００，０００ｈＰａ、好ましくは７０，０００～３００，０００ｈＰａの圧力で行うことを特徴とする上記９～１１のいずれかに記載の製造方法。
１３．
工程ｃ）を、各活性物質の（標準条件下）融点より低い温度で、又は活性物質混合物の場合最も高い融点を有する固体の融点より低い温度で、好ましくは４０℃～２２０℃、より好ましくは５０℃～２２０℃の温度で行うことを特徴とする上記９～１２のいずれかに記載の製造方法。
１４．
工程ｄ）において、ジェット・ディスパーサー、他の高圧ホモジナイザー又はローター／ステータ原理に基づいて動作するホモジナイザーを用いて、細かい分散物を得るために、エマルジョンを均質化することを特徴とする上記９～１３のいずれかに記載の製造方法。
１５．
工程ｄ）を、４０，０００ｈＰａ～１，６００，０００ｈＰａ、より好ましくは５０，０００ｈＰａ～１，０００，０００ｈＰａのホモジナイザーの差圧下で行うことを特徴とする上記１４に記載の製造方法。
１６．
工程ｅ）において、カプセル化のために、１０～５０重量％の濃度のコーティング材料Ｅ）の溶液と、及び適切であれば添加剤Ｃ）と、分散物を混合することを特徴とする上記９～１５のいずれかに記載の製造方法。
１７．
工程ｅ）において、工程ｄ）からの分散物の圧力を突然低下させ、好ましくは同時に乾燥ガス、特に乾燥空気又は不活性ガス、より好ましくは窒素又は貴ガスを用いる噴霧乾燥に付すことを特徴とする上記９～１６のいずれかに記載の製造方法。
１８．
工程ｅ）の噴霧乾燥は、１００℃～２００℃、好ましくは１２０℃～１８０℃の乾燥ガス入口温度、及び５０℃～１００℃、好ましくは６０℃～９０℃の乾燥ガス出口温度で行うことを特徴とする上記１７に記載の製造方法。
１９．
工程ｅ）において、工程ｄ）からのエマルジョンに存する水を凍結乾燥によって除去することを特徴とする上記９～１６のいずれかに記載の製造方法。
２０．
流体Ｄ）は、下記の群から選択されることを特徴とする上記９～１９のいずれかに記載の製造方法：１～６の炭素原子を有する炭化水素、特にメタン、エタン、プロパン、ブタン、ペンタン、ｎ－ヘキサン、ｉ－ヘキサン、二酸化炭素、フロン、窒素、貴ガス、ガス状酸化物、例えば、N_2O、CO_2、アンモニア、１～４の炭素原子を有するアルコール、特にメタノール、エタノール、イソプロパノール、ｎ－プロパノール、ブタノール、ハロゲン化炭化水素、及び上記物質の混合物。
２１．
上記１～８のいずれかに記載の粉末状活性物質配合物が含んで成る活性物質を適用するための配合物の使用。
２２．

適当であれば、予め増量剤及び／又は界面活性物質を用いて希釈した後、上記１～８のいずれかに記載の粉末状活性物質配合物を、目標有機体及び／又はその生息場所に運ぶことを特徴とする活性物質の適用方法。

２３．

上記９～２０のいずれかに記載の製造方法を行うための装置であって、少なくとも、圧力を発生するために適するポンプ（３）を介して熱交換器（４）と接続されており、攪拌機が設けられている耐圧容器（２）の中に、加圧下で圧縮性流体Ｄ）を計量するためのデバイスを含んで成り、均質化装置（５）、特にジェット・ディスパーサーが、熱交換器（４）と接続されており、バルブで閉鎖可能なパイプラインが、均質化装置（５）から容器（２）に戻り及び必要であれば、パイプラインが均質化装置（５）からポンプが設けられている冷却回路に導かれ、ここで、冷却回路の出口ラインは計量型ポンプ（９）及び必要であれば混合容器と接続されており、後者から導かれるパイプラインは噴霧乾燥機（１０）と接続されている装置。